

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
6. November 2003 (06.11.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 03/091254 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 487/04,  
A01N 43/90

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/03833

(22) Internationales Anmeldedatum:  
14. April 2003 (14.04.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 18 592.1 26. April 2002 (26.04.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-  
SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789  
Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GEBAUER, Olaf  
[DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). GREUL,  
Nico, Jörg [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Le-  
ichlingen (DE). HEINEMANN, Ulrich [DE/DE]; Am  
Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). MAURER,  
Fritz [DE/DE]; Brahmstr. 36, 40789 Monheim (DE).  
KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am Vorend 52,  
51467 Bergisch Gladbach (DE). ELBE, Hans-Ludwig  
[DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). GAYER,  
Herbert [AT/DE]; Sandstr. 66, 40789 Monheim (DE).  
DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Mon-  
heim (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Salierring 33,  
50677 Köln (DE). HILLEBRAND, Stefan [DE/DE];  
Lothringer Str. 22, 41462 Neuss (DE). BOIE, Christiane  
[DE/DE]; Landrat Trimborn Str. 47, 42799 Leichlin-  
gen (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike  
[DE/DE]; Oberer Markeweg 85, 56566 Neuwied (DE).

MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper  
Weg 48, 42799 Leichlingen (DE). KUCK, Karl-Heinz  
[DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE  
AKTIENGESELLSCHAFT; Law and Patents, Patents  
and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,  
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,  
UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

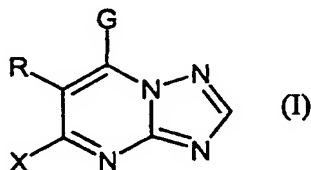
Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu  
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die  
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,  
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,  
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ,  
NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK,  
SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE



(57) Abstract: Novel triazolopyrimidines of formula (I) where G, R and X have the  
meanings given in the description, a method for production of said substances and  
use thereof for the treatment of undesired microorganisms.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazolopyrimidine der Formel (I) in welcher G, R  
und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, ein Verfahren zur  
Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünsch-  
ten Mikroorganismen.

WO 03/091254 A1



IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht

- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

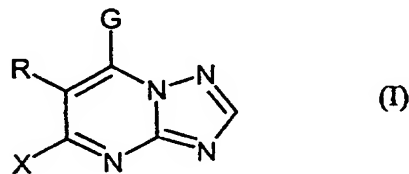
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

### Triazolopyrimidine

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, ein Verfahren zu ihrer  
5 Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikro-  
organismen.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide  
Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A-0 550 113, WO 94/20501, EP-A-0 613 900,  
10 US 5 612 345, EP-A-0 834 513, FR-A-2 784 991, WO 98/46607 und WO 98/46608).  
Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen unbefriedigend.

Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel



15

in welcher

G für gegebenenfalls substituiertes, mono- oder polycyclisches, gesättigtes, un-  
20 gesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl steht, das über ein Stickstoffatom  
gebunden ist, wobei dieses Stickstoffatom im Heterocyclus mit einem  
weiteren Stickstoff- oder Sauerstoffatom verbunden ist, und wobei der  
Heterocyclus gegebenenfalls noch ein oder zwei weitere Sauerstoff-,  
Stickstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei jedoch keine zwei  
25 Sauerstoffatome direkt benachbart stehen können,

R für gegebenenfalls einfach bis fünffach substituiertes Aryl steht und

X für Halogen steht,

sowie Säureadditionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

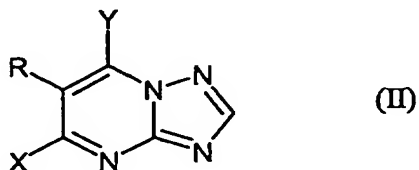
- 5 G für gegebenenfalls substituiertes, mono- oder polycyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl steht, das über ein Stickstoffatom gebunden ist, wobei dieses Stickstoffatom im Heterocyclus mit einem weiteren Stickstoffatom verbunden ist, und wobei der Heterocyclus gegebenenfalls noch ein oder zwei weitere Sauerstoff-, Stickstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei  
10 jedoch keine zwei Sauerstoffatome direkt benachbart stehen können,

gefunden.

- Die erfindungsgemäßen Verbindungen können je nach Substitutionsmuster gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere  
15 von Stereoisomeren, wie z.B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Ist R an beiden Atomen, die der Bindungsstelle benachbart sind, ungleich substituiert, können die betreffenden Verbindungen in einer besonderen Form der Stereoisomerie vorliegen, nämlich  
20 als Atropisomere.

Weiterhin wurde gefunden, dass man die Triazolopyrimidine der Formel (I) erhält, wenn man -

- 25 Dihalogentriazolopyrimidine der Formel



in welcher

R und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y für Halogen steht,

5

mit Heterocyclen der Formel



in welcher

10

G die oben angegebene Bedeutung hat,

oder mit Säureadditionssalzen von Heterocyclen der Formel (III),

15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass sich die Triazolopyrimidine der Formel (I) bzw. deren Säureadditions-Salze sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikro-  
20 organismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere mikrobizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähn-  
25 lichsten, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

Die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

30 G steht bevorzugt für mono- oder bicyclisches, gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl mit insgesamt bis zu 12 Gliedern, das über ein

Stickstoffatom gebunden ist, wobei dieses Stickstoffatom im Heterocyclus mit einem weiteren Stickstoff- oder Sauerstoffatom verbunden ist, und wobei der Heterocyclus gegebenenfalls noch ein oder zwei weitere Sauerstoff-, Stickstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei jedoch keine zwei Sauerstoffatome direkt benachbart stehen können,

wobei die Heterocyclen einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Cyano, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen oder durch Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in der Alkoxygruppe.

R steht bevorzugt für Phenyl, welches gegebenenfalls einfach bis vierfach gleich oder verschieden substituiert ist durch:

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5       jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinioalkyl oder Alkoximinioalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

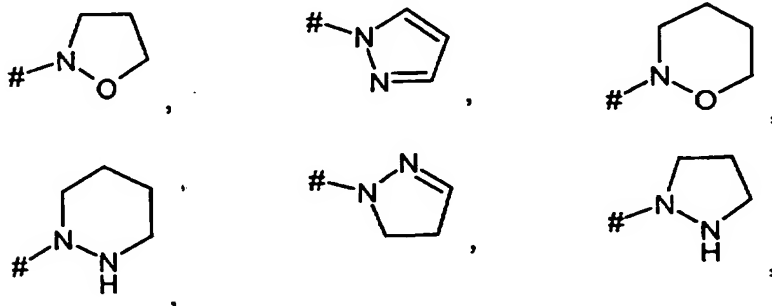
10       jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlen-

15       stoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

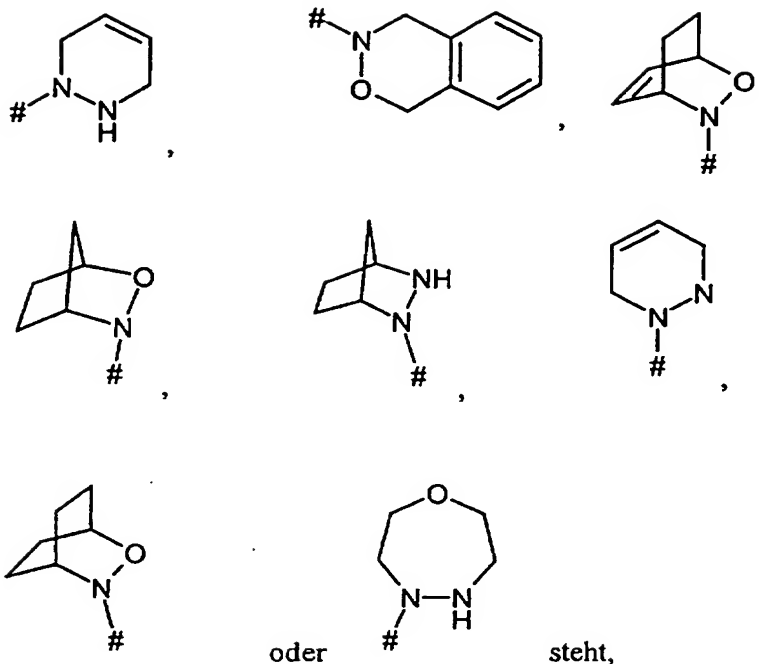
X       steht bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom.

20       Besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

G       für einen Heterocyclyl-Rest der Formel



- 6 -



5 wobei # für die Verknüpfungsstelle steht und wobei jeder der Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl und/oder Ethoxycarbonyl,

R für Phenyl steht, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden  
 10 substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluor-  
 15 methylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methox-



iminoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

5 jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes in 2,3-Position oder 3,4-Position verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy, und

X für Brom oder Chlor steht.

10

Ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

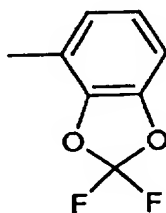
G und X die Bedeutungen haben, die schon als besonders bevorzugt genannt wurden, und

15

R für Phenyl steht, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Trifluormethyl, Trifluormethoxy und/oder Trifluormethylthio, oder

20

R für den Rest der Formel



steht.

25

Bevorzugt sind auch Säureadditions-Salze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen G für mono- oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes

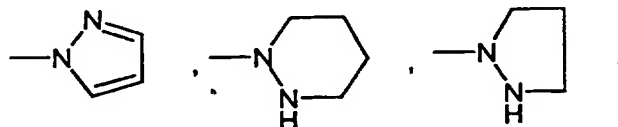
Heterocyclyl mit bis zu 12 Ringgliedern steht, das über ein Stickstoffatom gebunden ist, wobei dieses Stickstoffatom im Heterocyclus mit einem weiteren Stickstoffatom verbunden ist, und wobei der Heterocyclus gegebenenfalls noch ein oder zwei weitere Sauerstoff-, Stickstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei jedoch keine  
5 zwei Sauerstoffatome direkt benachbart stehen können, wobei die Heterocyclen einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Cyano, Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen oder durch Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in der Alkoxygruppe, und R  
10 und X diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure, mono- und  
15 bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z.B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z.B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

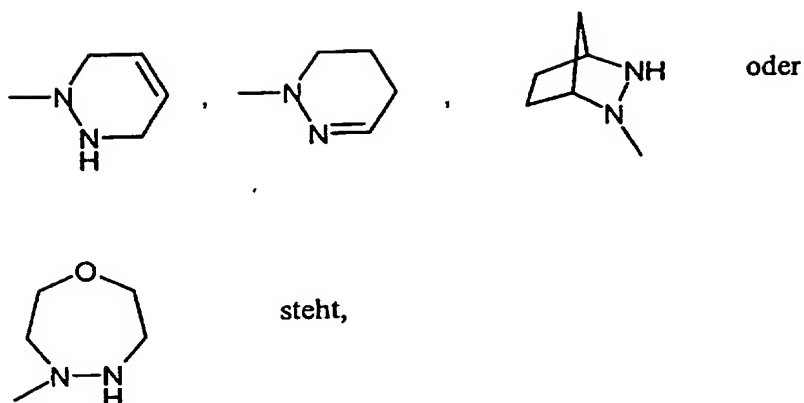
20

Besonders bevorzugt sind Salze, die durch Addition von Chlorwasserstoffsäure, Phosphorsäure, p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure oder Saccharin an Triazolopyrimidine der Formel (I) entstehen, in denen

25 G für einen Heterocyclyl-Rest der Formel



- 9 -



5 wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl und/oder Ethoxycarbonyl, und

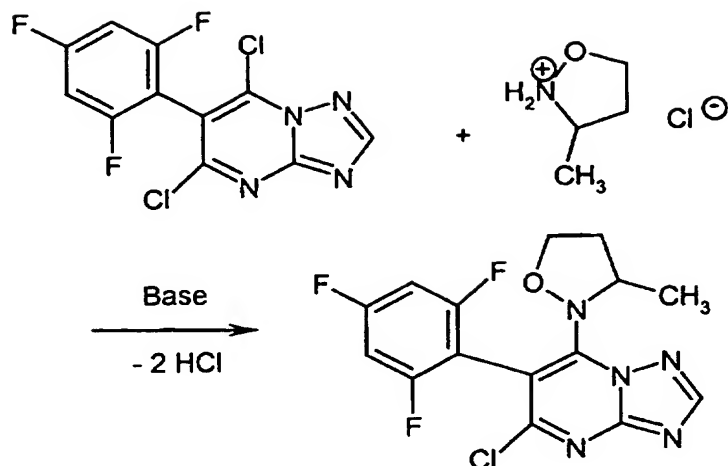
10 R und X diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als besonders bevorzugt genannt wurden.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

15 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte.

20 Verwendet man 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5a]-pyrimidin und 3-Methyl-isoxazolidin-Hydrochlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

- 10 -



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogentriazolopyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben R und X vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R und X angegeben wurden. Y steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Die Dihalogentriazolopyrimidine der Formel (II) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vgl. z.B. US 5 612 345).

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens als Ausgangsstoffe benötigten Heterocyclen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) hat G vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für G angegeben wurde.

Die Heterocyclen der Formel (III) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vgl. z. B. J. Chem. Soc. 1942, 432; Can. J. Chem.

(1976), 54(6), 867-70; Tetrahedron Lett. (1993), 34(36), 5673-6; Tetrahedron Lett. (1973), 30, 2859-2862).

Die Heterocyclen der Formel (III) können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens auch in Form ihrer Säureadditionssalze eingesetzt werden. Als  
5 Säureadditionssalze kommen dabei vorzugsweise diejenigen Verbindungen in Frage, die durch Addition von denjenigen Säuren, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditionssalze genannt wurden, an Heterocyclen der Formel (III) entstehen. Bevorzugt sind Hydrochloride und Acetate  
10 von Heterocyclen der Formel (III).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise  
15 Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester  
20 wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

25 Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens alle üblichen Säurebindemittel in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ammoniak oder tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Weiterhin kommen Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate,  
30

-carbonate oder -hydrogencarbonate infrage, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat.

5

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 80°C.

10 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens arbeitet man im Allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem Druck bis zu 10 bar oder unter vermindertem Druck bis zu 0,1 bar zu arbeiten.

15 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens setzt man auf 1 mol an Dihalogentriazolopyrimidin der Formel (II) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 Mol an einer Verbindung der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

20 Zur Herstellung von Säureadditions-Salzen von Triazolopyrimidinen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Säuren in Frage, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditions-Salze als bevorzugte Säuren genannt wurden.

25 Die Säureadditions-Salze der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten inerten Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, z.B. Chlorwasserstoffsäure, erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösungsmittel gereinigt werden.

30

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

5 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

10 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

15

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

20

Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;

Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;

25

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder

*Pseudoperonospora cubensis*;

30

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

- Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
- 5 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
- 10 Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
- Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
- 15 (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
- (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- 20 Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- 25 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
- 30 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;



Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

5

Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;

Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;

10

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

15

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

20

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

25

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum,

30

innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

- 5 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

- 10 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- und Alternaria-Arten, oder von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen Pyricularia-Arten, einsetzen.

- 15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

- 20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

- 25 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich  
30 der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe

der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielsweise Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie Alternaria tenuis,
- Aspergillus, wie Aspergillus niger,
- Chaetomium, wie Chaetomium globosum,
- Coniophora, wie Coniophora puetana,
- Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
- Penicillium, wie Penicillium glaucum,
- Polyporus, wie Polyporus versicolor,
- Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
- Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
- Trichoderma, wie Trichoderma viride,
- Escherichia, wie Escherichia coli,
- Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,

Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

- Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie
- 5      Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.
- 10      Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streck-
- 15      mittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen,
- 20      Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-
- 25      Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diato-
- 30      meenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen

sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

**Fungizide:**

- Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,
- 5 Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,
- 10 Calciumpolysulfid, Carpropamid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,
- 15 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 20 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenhexamid, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, -Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-
- 25 Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Fluoxastrobin,
- Guazatin,
- 30 Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

- Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Iprovalicarb, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,
- 5 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,
- 10 Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,
- Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,
- 15 Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,
- Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin,
- 20 Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur, Prothioconazole,
- Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen
- Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine
- 25 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
- 30 Uniconazol,



- Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,  
Zarilamid, Zineb, Ziram sowie  
Dagger G,  
OK-8705,  
5 OK-8801,  
 $\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy- $\alpha$ -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 $\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-  
10 triazol-1-ethanol,  
(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,  
(E)- $\alpha$ -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,  
1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,  
15 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,  
1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,  
1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,  
1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,  
1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,  
20 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,  
2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,  
2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,  
2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,  
2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,  
25 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,  
2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,  
2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- $\beta$ -D-glycopyranosyl)- $\alpha$ -D-glucopyranosyl]-amino]-4-  
methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,  
2-Aminobutan,  
30 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,  
2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,

- 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,  
2-Phenylphenol(OPP),  
3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,  
3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,  
5 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
8-Hydroxychinolinsulfat,  
10 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-  
hydrochlorid,  
15 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,  
Kaliumhydrogencarbonat,  
Methantetrathiol-Natriumsalz,  
Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
20 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
25 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanocarboxamid,  
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
30 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,

O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiaazol-7-carbothioat,  
spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,  
4-[3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

5

**Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,  
Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam,  
10 Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,  
15 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,  
Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,  
Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb,  
20 Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin,  
Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin,  
Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap,  
25 Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron,  
Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-  
Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine,  
Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin,  
Cypermethrin, Cyromazine,

30

- 26 -

- Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,
- 5 Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomophtora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,
- Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate,
- 10 Fipronil, Fluazuron, Flubrocycythrinate, Flucyclohexuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,
- Granuloseviren
- 15 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
- Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,
- 20 Kempolyederviren
- Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
- Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
- 25 Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, Monocrotophos,
- Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron
- 30 Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,  
Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,  
Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat,  
5 Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion,  
Pirimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

10 Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

15 Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,  
Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon Theta-  
cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam  
hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,  
Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon,  
Triflumuron, Trimethacarb,

20

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

25 Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-  
furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

30

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

- 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-  
imin
- 2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol  
5 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid  
10 3-Methylphenyl-propylcarbamat
- 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
- 15 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-  
3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-  
pyridazinon  
20 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon  
Bacillus thuringiensis strain EG-2348
- Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid  
25 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-  
ester
- [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid  
30 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat  
N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

5 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-  
1-carboxamid

N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin

10 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

15

N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid

3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-  
propoxy]-benzol

20

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit  
Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

25 Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch  
sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimyko-  
tisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze,  
Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans,  
Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie  
Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophy-  
30 ton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die

Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykologischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus be-  
5 reiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritz-  
pulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die  
Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen,  
Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die  
10 Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoff-  
zubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das  
Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwand-  
mengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden.  
15 Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im  
allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha.  
Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen  
zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und  
10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Auf-  
20 wandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugs-  
weise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile  
behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vor-  
25 kommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung  
oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren  
Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene  
Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls  
in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified  
30 Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von  
Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.



Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken  
5 gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die  
10 erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz  
15 gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

20 Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits")  
25 verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder  
30 Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und

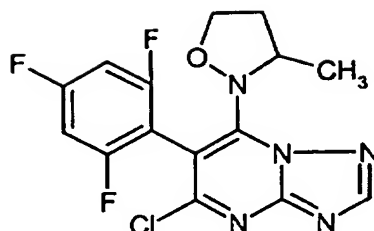
mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die

unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

5

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders  
10 hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe werden durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

**Herstellungsbeispiele****Beispiel 1**

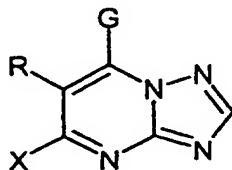
5

180 mg (0,56 mMol) des 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin, 120 mg (0,97 mMol) 3-Methylisoxazolidin Hydrochlorid und 335 mg Kaliumcarbonat werden 18 Stunden unter Argon bei Raumtemperatur in 10 ml Acetonitril gerührt. Die Reaktionsmischung wird mit 10 ml Wasser versetzt, die  
 10 organische Phase wird abgetrennt, mit 10 ml gesättigter Ammoniumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit Petrolether/Essigester (10:1) an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 250 mg (49 % der Theorie) an 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(3-methyl-2-isoxazolidinyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.

15 HPLC: logP = 2,76

Analog Beispiel 1 sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Verfahrensbeschreibung werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel

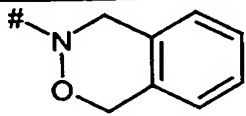
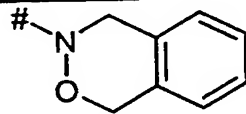
20



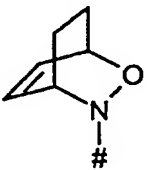
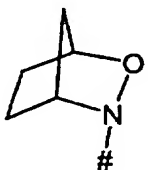
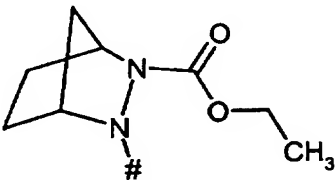
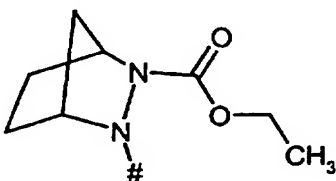
(I)

enthalten.

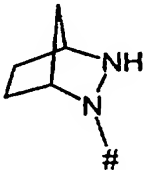
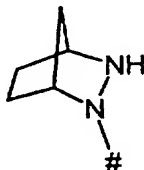
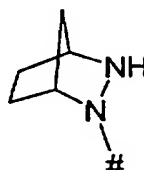
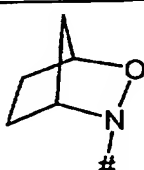
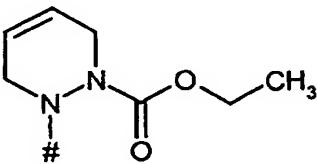
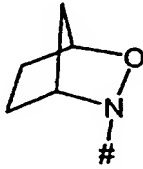
**Tabelle 1**

| Bsp. Nr. | X  | G   | R                                   | logP | FP.: (°C) |
|----------|----|---|-------------------------------------|------|-----------|
| 2        | Cl | N-Isoxazolidinyl  | 2,6-Difluorphenyl                   | 2,07 |           |
| 3        | Cl |  | 2,6-Difluorphenyl                   | 3,33 |           |
| 4        | Cl | 4-Cyano-1-pyrazolyl   | 2,6-Dichlor-4-trifluormethoxyphenyl | 3,68 |           |
| 5        | Cl |  | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 3,53 |           |
| 6        | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 2,92 |           |
| 7        | Cl | N-Isoxazolidinyl  | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 2,4  |           |
| 8        | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2-Chlor-4-fluorphenyl               | 3,11 |           |
| 9        | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2,4-Difluorphenyl                   | 2,84 |           |
| 10       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 2,68 |           |
| 11       | Cl | 4,5-Dihydro-pyrazol-1-yl  | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 2,34 | 123-26    |
| 12       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2-Chlor-6-fluorphenyl               | 2,67 | 183-5     |
| 13       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl    | 2,97 | 160-6     |
| 14       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2-Chlor-5-trifluormethylthiophenyl  | 3,72 | 178-80    |
| 15       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2-Chlor-5-trifluormethylphenyl      | 3,25 | 196-8     |
| 16       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2-Chlor-3-trifluormethylphenyl      | 3,16 | 142-4     |

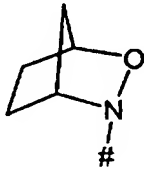
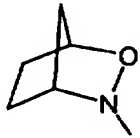
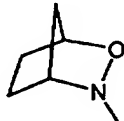
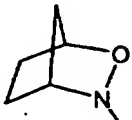
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

| Bsp. Nr. | X  | G   | R  | logP | FP.: (°C) |
|----------|----|---|--|------|-----------|
| 17       | Cl |    | 2,4,6-Trifluorophenyl                      | 2,82 |           |
| 18       | Cl |    | 2,4,6-Trifluorophenyl                      | 2,75 |           |
| 19       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,6-Dichlor-4-trifluormethoxyphenyl        | 3,81 |           |
| 20       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl | 3,64 | 208-9     |
| 21       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,6-Dichlorphenyl                          | 2,88 | 185-7     |
| 22       | Cl | 4-Fluor-4-methyl-pyrazolidin-1-yl   | 2,4,6-Trifluorophenyl                      | 2,53 | 141-3     |
| 23       | Cl |  | 2,4,6-Trifluorophenyl                      | 2,8  | 199-02    |
| 24       | Br | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,4,6-Trifluorophenyl                      | 2,73 |           |
| 25       | Cl |  | 2-Chlor-6-fluorophenyl                     | 2,73 | 192-94    |
| 26       | Cl | 3,6-Dihydro-2H-pyridazin-1-yl   | 2,4,6-Trifluorophenyl                      | 2,53 | 201-03    |

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

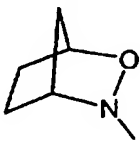
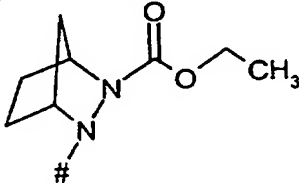
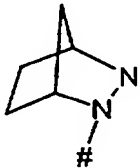
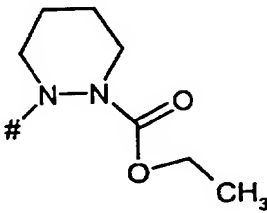
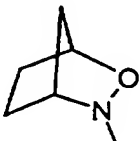
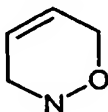
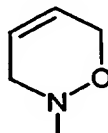
| Bsp.<br>Nr. | X  | G   | R                      | logP | FP.: (°C) |
|-------------|----|---|------------------------|------|-----------|
| 27          | Cl |    | 2,4,6-Trifluorophenyl  | 2,65 | 178-80    |
| 28          | Cl |    | 2-Chlor-6-fluorophenyl | 2,59 | 175-7     |
| 29          | Cl |   | 2,6-Dichlorophenyl     | 2,78 |           |
| 30          | Cl |  | 2,6-Difluorophenyl     | 2,53 |           |
| 31          | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2,6-Difluorophenyl     | 2,68 |           |
| 32          | Cl |  | 2,4,6-Trifluorophenyl  | 2,82 | Öl        |
| 33          | Cl |  | 2-Chlorophenyl         | 2,69 |           |

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

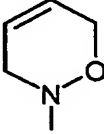
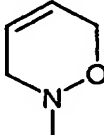
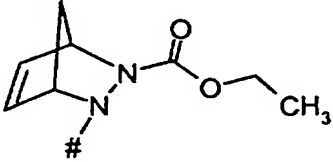
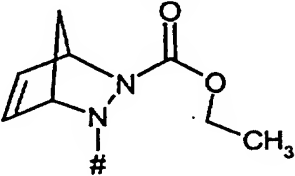
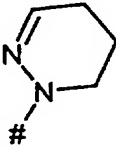
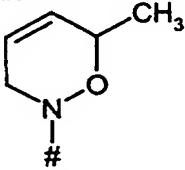
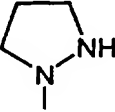
| Bsp.<br>Nr. | X  | G   | R                     | logP | FP.: (°C) |
|-------------|----|---|-----------------------|------|-----------|
| 34          | Cl |    | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 2,74 |           |
| 35          | Cl | 3-Methyl-1,2-oxazinan-N-yl  | 2,4,6-Trifluorphenyl  | 3,23 |           |
| 36          | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 2,92 |           |
| 37          | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2-Chlorphenyl         | 2,87 |           |
| 38          | Cl | 1,2-Oxazinan-N-yl   | 2,4-Dichlorphenyl     | 3,51 |           |
| 39          | Cl | 3-Methyl-1,2-oxazinan-N-yl  | 2,6-Difluorphenyl     | 2,96 |           |
| 40          | Cl | 3-Methyl-1,2-oxazinan-N-yl  | 2-Chlor-4-fluorphenyl | 3,59 |           |
| 41          | Cl | 3-Methyl-1,2-oxazinan-N-yl  | 2-Chlorphenyl         | 3,17 |           |
| 42          | Cl | 3-Methyl-isoxazolidin-N-yl  | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 2,74 |           |
| 43          | Cl |  | 2,4-Difluorphenyl     | 2,67 |           |
| 44          | Cl |  | 2-Chlor-4-fluorphenyl | 2,89 |           |
| 45          | Cl |  | 2,4-Dichlorphenyl     | 3,3  |           |



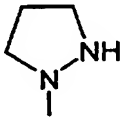
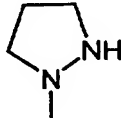
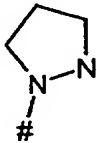
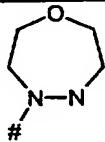
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

| Bsp. Nr. | X  | G   | R                                   | logP | FP.: (°C) |
|----------|----|---|-------------------------------------|------|-----------|
| 46       | Cl |    | 2,4-Difluor-6-trifluormethyl-phenyl | 3,1  |           |
| 47       | Cl |    | 2,6-Difluorphenyl                   | 2,57 | 188-90    |
| 48       | Cl |   | 2-Chlor-4-fluorphenyl               | 2,74 | 92-4 Zer. |
| 49       | Cl |  | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 2,88 | 177-80    |
| 50       | Cl |  | 2,4,6-Trifluorphenyl                | 2,97 |           |
| 51       | Cl |  | 2,4,6-Trifluorphenyl                |      |           |
| 52       | Cl |  | 2-Chlorphenyl                       | 2,74 |           |

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

| Bsp.<br>Nr. | X  | G   | R                     | logP | FP.: (°C) |
|-------------|----|---|-----------------------|------|-----------|
| 53          | Cl |    | 2-Chlor-4-fluorphenyl | 2,93 |           |
| 54          | Cl |    | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 2,78 |           |
| 55          | Cl |   | 2,4,6-Trifluorphenyl  | 2,79 | Paste     |
| 56          | Cl |  | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 3,01 |           |
| 57          | Cl |  | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 2,58 |           |
| 58          | Cl |  | 2,4,6-Trifluorphenyl  | 3,12 |           |
| 59          | Cl |  | 2-Chlor-6-fluorphenyl | 2,29 | 182-4     |

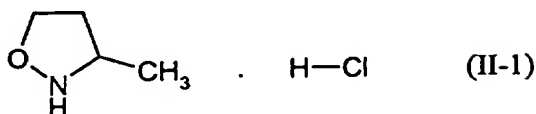
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

| Bsp. Nr. | X  | G   | R                                  | logP | FP.: (°C) |
|----------|----|---|------------------------------------|------|-----------|
| 60       | Cl |    | 2-Chlor-4-fluorphenyl              | 2,39 | 164-7     |
| 61       | Cl |    | 2,4,6-Trifluorphenyl               | 2,32 |           |
| 62       | Cl |    | 2-Chlorphenyl                      | 2,2  |           |
| 63       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,6-Difluorphenyl                  | 2,47 | 188-9     |
| 64       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,4-Difluorphenyl                  | 2,57 | 180-2     |
| 65       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2-Chlorphenyl                      | 2,61 | 217-8     |
| 66       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2-Chlor-4-fluorphenyl              | 2,8  | 210-2     |
| 67       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,4-Difluor-6-trifluormethylphenyl | 3,06 | 160-1     |
| 68       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,6-Difluor-4-trifluormethylphenyl | 3,26 | Paste     |
| 69       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 2,4-Dichlorphenyl                  | 3,22 | 165-6     |
| 70       | Cl | Tetrahydro-pyridazin-1-yl   | 4-Fluor-2-trifluormethylphenyl     | 2,98 | 213-5     |
| 71       | Cl |  | 2,4,6-Trifluorphenyl               | 2,18 |           |

# steht in der obigen Tabelle für die Verknüpfungsstelle.

\*) Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.

5 A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

**Herstellung eines Vorproduktes der Formel (II)****Beispiel 72**

5

Zu einer Lösung von 1,6 g Kalium t-Butanolat in 40 ml t-Butanol gibt man 1,83 g (17,4 mMol) Ethylhydroxycarbamat und 1 g (4,6 mMol) 1,3-Dibrombutan und rührt 7 Stunden bei 65°C. Die Reaktionsmischung wird unter vermindertem Druck eingengt, der Rückstand wird mit Ether und Wasser versetzt und die organische Phase wird abgetrennt. Die wässrige Phase wird noch zweimal mit Ether extrahiert, die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingengt. Man erhält 1 g rohes ca. 80 %iges N-Ethoxycarbonyl-3-methylisoxazolidin mit einem logP-Wert von 1,22.

15

950 mg davon werden in 10 ml 16 %iger Salzsäure 3 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Das Gemisch wird unter vermindertem Druck eingengt, dreimal mit 5 ml Methanol verrührt und jedesmal filtriert. Die vereinigten Filtrate werden unter vermindertem Druck eingengt. Man erhält 560 mg 3-Methylisoxazolidin Hydrochlorid mit einem logP-Wert von 1.22

20

## Verwendungsbeispiele

### Beispiel A

#### 5      Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:      24,5 Gewichtsteile Aceton  
                         24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator:          1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

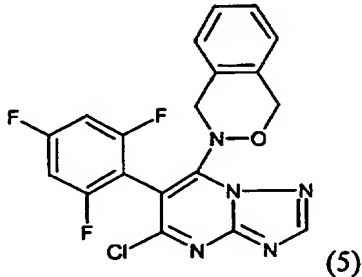
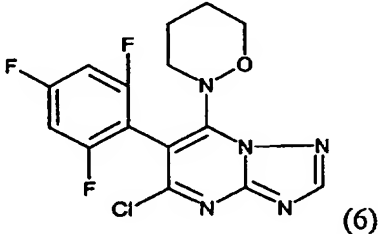
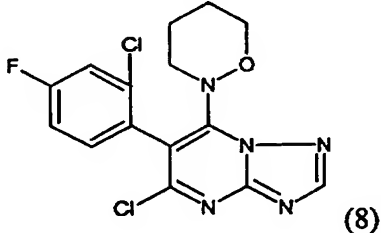
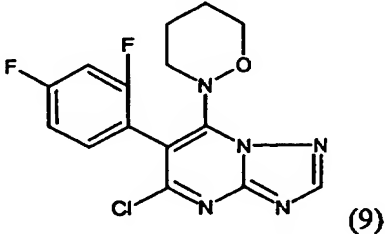
25

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

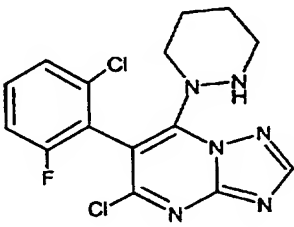
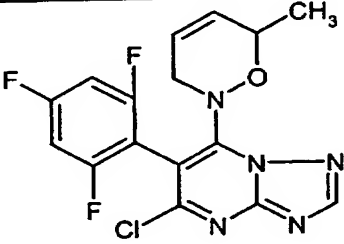
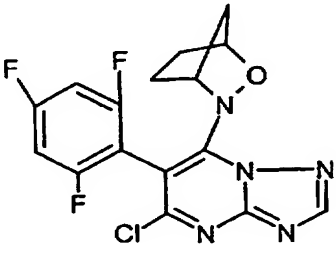
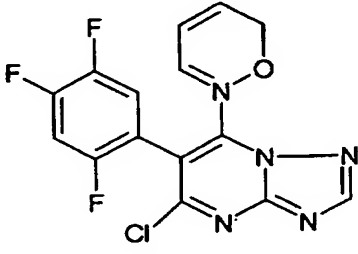
**Tabelle A**

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff  | Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in % |
|--|-----------------------------------|-------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(5) | 100                               | 100               |
| <br>(6)                    | 100                               | 100               |
| <br>(8)                   | 100                               | 100               |
| <br>(9)                   | 100                               | 96                |

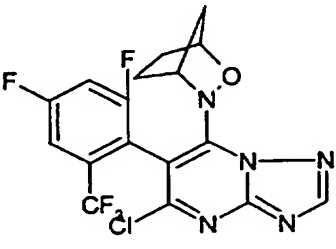
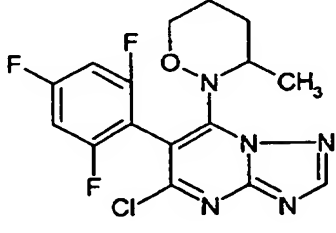
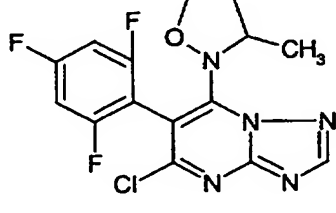
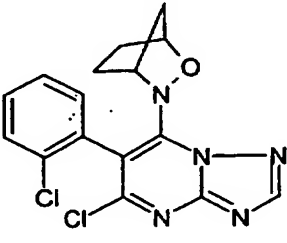
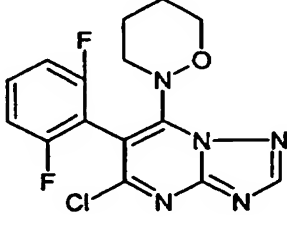
**Tabelle A** (Fortsetzung)

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in % |
|---|-----------------------------------|-------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(12) | 100                               | 100               |
| <br>(58)                    | 100                               | 100               |
| <br>(18)                   | 100                               | 100               |
| <br>(51)                   | 100                               | 100               |

**Tabelle A** (Fortsetzung)

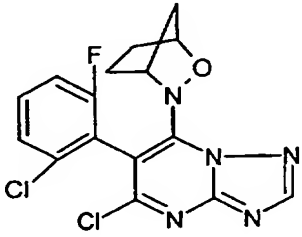
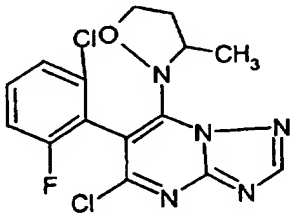
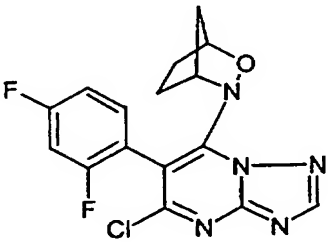
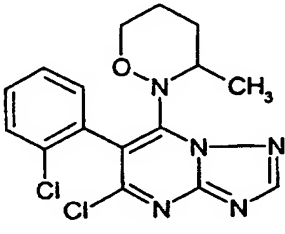
Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in % |
|---|-----------------------------------|-------------------|
| <br>(46)   | 100                               | 100               |
| <br>(35)  | 100                               | 100               |
| <br>(1)  | 100                               | 100               |
| <br>(33) | 100                               | 99                |
| <br>(31) | 100                               | 100               |



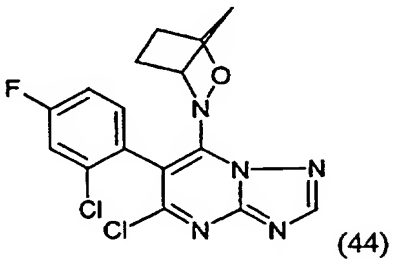
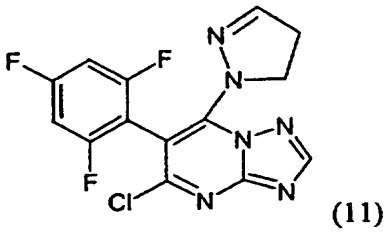
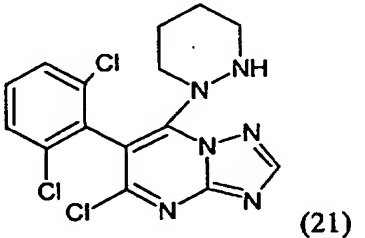
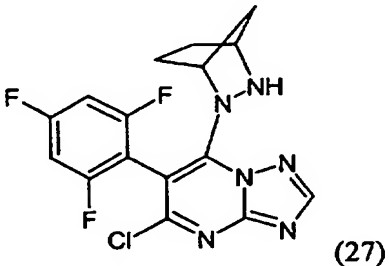
**Tabelle A** (Fortsetzung)

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in % |
|---|-----------------------------------|-------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(34) | 100                               | 100               |
| <br>(42)                    | 100                               | 100               |
| <br>(43)                   | 100                               | 100               |
| <br>(41)                   | 100                               | 99                |

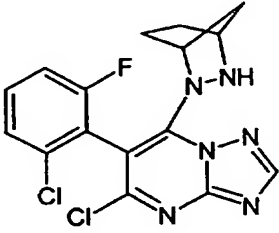
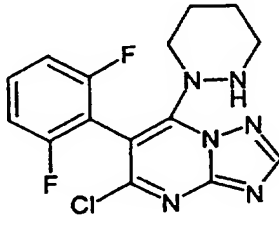
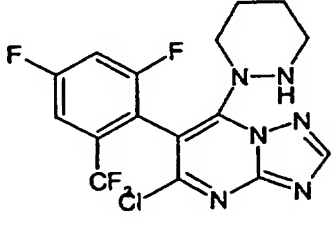
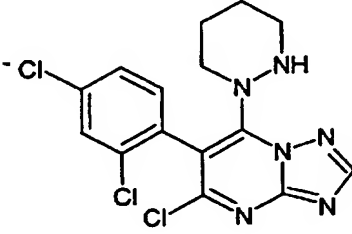
**Tabelle A** (Fortsetzung)

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in % |
|---|-----------------------------------|-------------------|
| Erfindungsgemäß:  |                                   |                   |
| <br>(44)   | 100                               | 100               |
| <br>(11)  | 100                               | 96                |
| <br>(21) | 100                               | 99                |
| <br>(27) | 100                               | 93                |

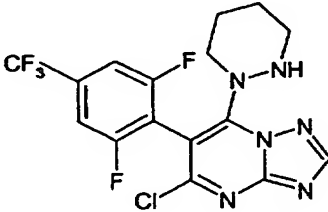
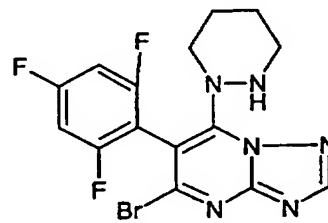
**Tabelle A** (Fortsetzung)

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in % |
|---|-----------------------------------|-------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(28) | 100                               | 100               |
| <br>(63)                    | 100                               | 96                |
| <br>(67)                   | 100                               | 100               |
| <br>(69)                   | 100                               | 95                |

**Tabelle A** (Fortsetzung)

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff  | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|--|--------------------------------------|----------------------|
| <p>Erfindungsgemäß</p>  <p>(68)</p> | 100                                  | 100                  |
|  <p>(24)</p>                       | 100                                  | 93                   |

**Beispiel B**

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

- 5      Lösungsmittel:      24,5 Gewichtsteile Aceton  
                                 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid  
            Emulgator:      1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

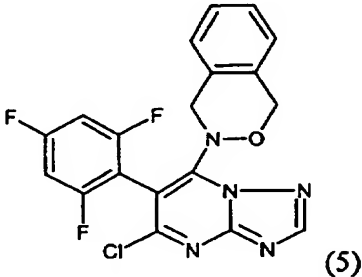
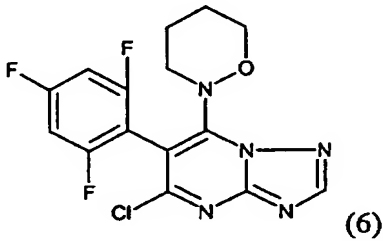
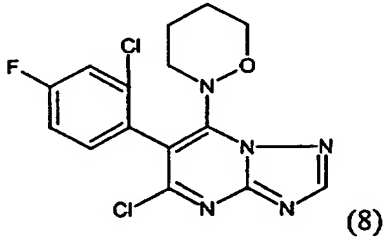
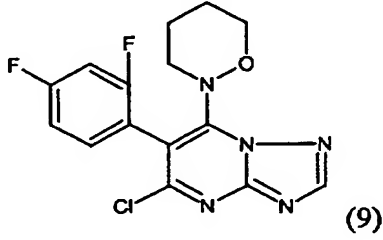
15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

20      2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

25      Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

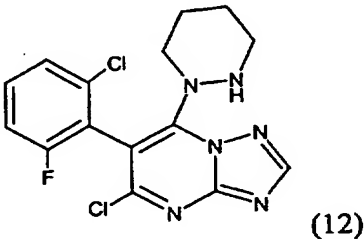
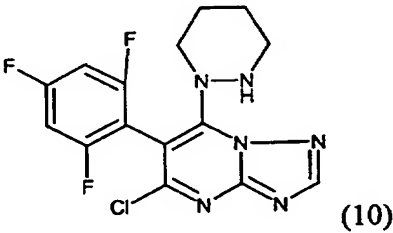
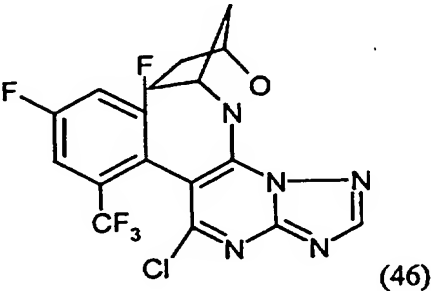
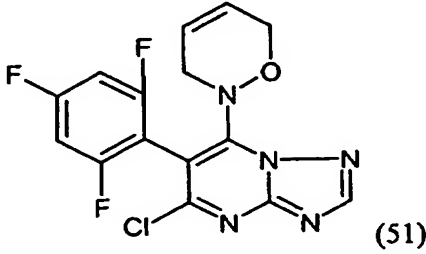
**Tabelle B**

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

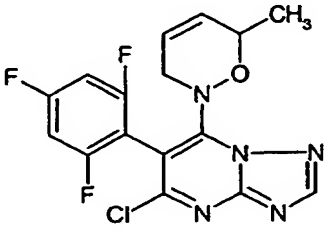
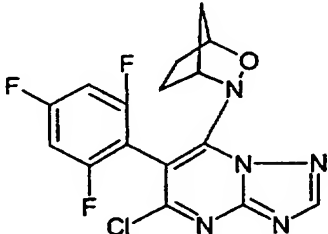
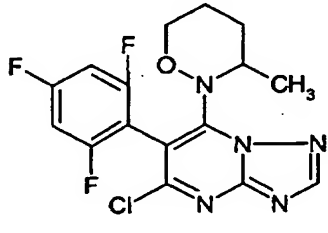
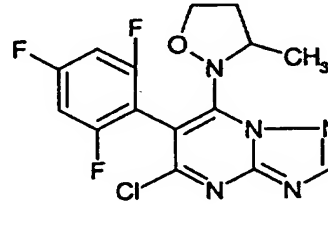
| Wirkstoff  | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|--|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(5) | 500                                  | 100                  |
| <br>(6)                    | 500                                  | 100                  |
| <br>(8)                   | 500                                  | 100                  |
| <br>(9)                   | 500                                  | 100                  |

**Tabelle B (Fortsetzung)**

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br>   | 500                                  | 100                  |
|                       | 500                                  | 100                  |
|                      | 500                                  | 100                  |
| Erfindungsgemäß:<br> | 500                                  | 100                  |

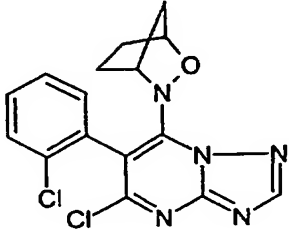
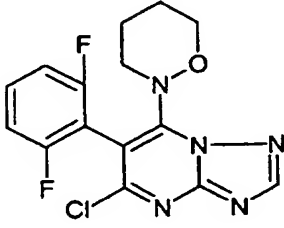
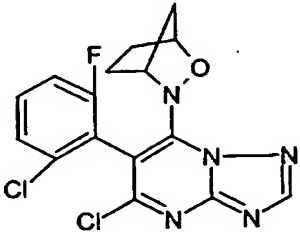
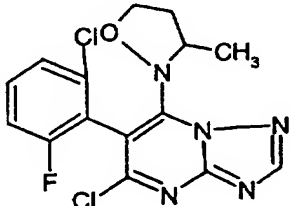
**Tabelle B (Fortsetzung)****Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(58) | 500                                  | 93                   |
| <br>(18)                    | 500                                  | 98                   |
| <br>(35)                   | 500                                  | 100                  |
| <br>(1)                    | 500                                  | 100                  |



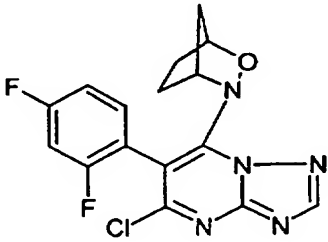
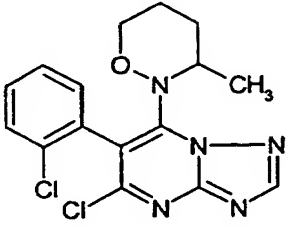
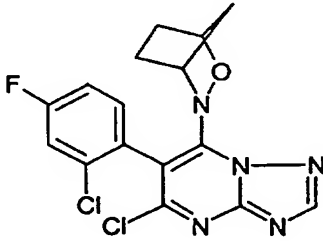
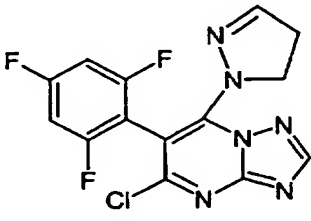
**Tabelle B** (Fortsetzung)

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(33) | 500                                  | 93                   |
| <br>(31)                    | 500                                  | 100                  |
| <br>(34)                   | 500                                  | 100                  |
| <br>(42)                   | 500                                  | 100                  |

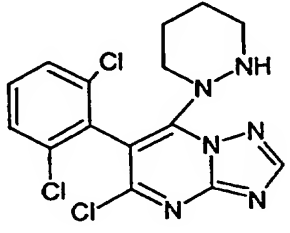
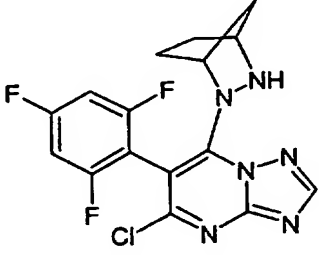
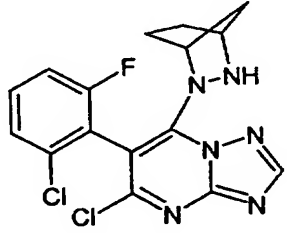
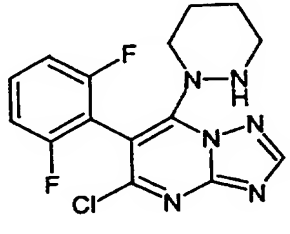
**Tabelle B (Fortsetzung)**

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(43) | 500                                  | 99                   |
| <br>(41)                    | 500                                  | 99                   |
| <br>(44)                   | 500                                  | 100                  |
| <br>(11)                   | 500                                  | 100                  |

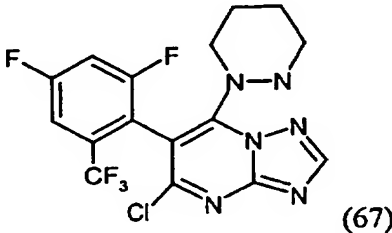
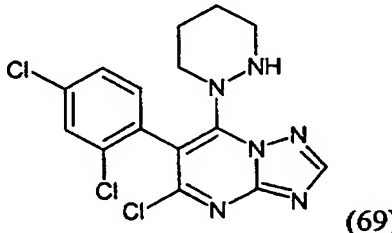
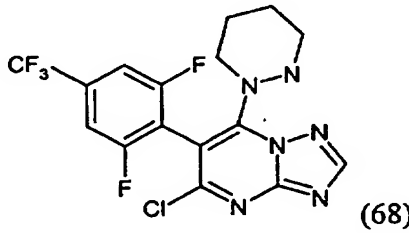
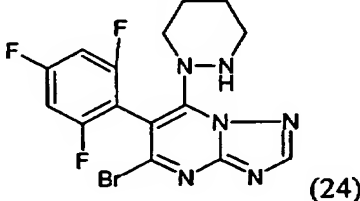
**Tabelle B** (Fortsetzung)

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(21) | 500                                  | 99                   |
| <br>(27)                    | 500                                  | 96                   |
| <br>(28)                   | 500                                  | 100                  |
| <br>(63)                   | 500                                  | 95                   |

**Tabelle B (Fortsetzung)**

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(67) | 500                                  | 100                  |
| <br>(69)                    | 500                                  | 95                   |
| <br>(68)                   | 500                                  | 95                   |
| <br>(24)                   | 500                                  | 100                  |

**Beispiel C****Alternaria-Test (Tomate) / protektiv**

|   |                |                  |                          |
|---|----------------|------------------|--------------------------|
| 5 | Lösungsmittel: | 49 Gewichtsteile | N, N - Dimethylformamid  |
|   | Emulgator:     | 1 Gewichtsteil   | Alkylarylpolyglykolether |

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

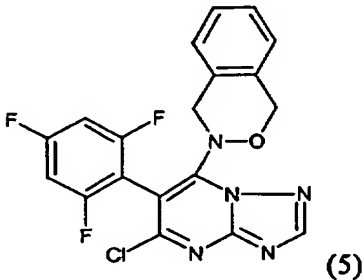
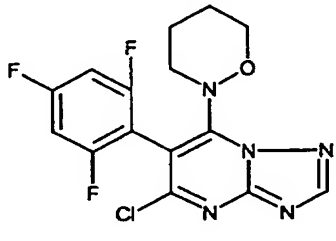
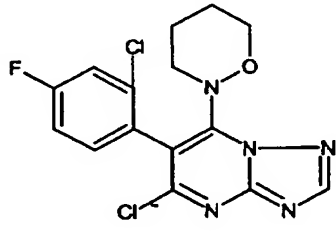
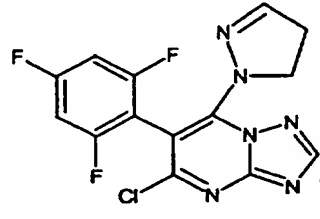
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Tomatenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Alternaria solani* inokuliert und stehen dann 24 h bei 100 % rel. Feuchte und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96 % rel. Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 20°C.

20 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

**Tabelle C**

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

| Wirkstoff  | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad in<br>% |
|--|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(5) | 750                                  | 100                  |
| <br>(6)                    | 750                                  | 100                  |
| <br>(8)                   | 750                                  | 100                  |
| <br>(11)                  | 750                                  | 95                   |

**Beispiel D****Pyricularia-Test (Reis) / protektiv**

- 5      Lösungsmittel:      50 Gew.-Teile N,N-Dimethylformamid  
Emulgator:              1 Gew.-Teil Alkylarylpolglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

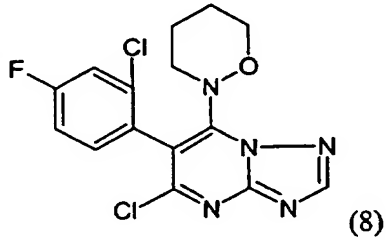
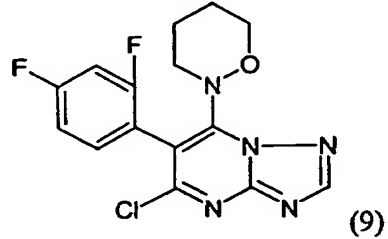
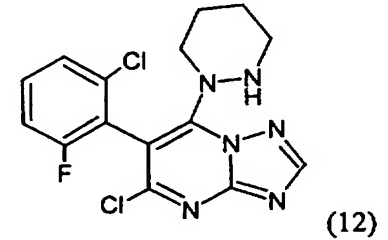
15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 25°C aufgestellt.

20      7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

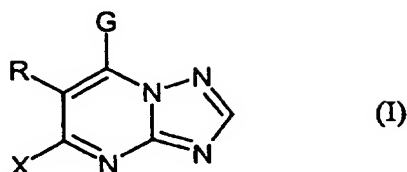
Wirkstoffe, - Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor..

**Tabelle D**

Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

| Wirkstoff  | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad<br>in % |
|--|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><br>(8) | 500                                  | 100                  |
| <br>(9)                    | 500                                  | 100                  |
| <br>(12)                  | 500                                  | 100                  |



**Patentansprüche****1. Triazolopyrimidine der Formel**

5

in welcher

10

G für gegebenenfalls substituiertes, mono- oder polycyclisches, gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl steht, das über ein Stickstoffatom gebunden ist, wobei dieses Stickstoffatom im Heterocyclus mit einem weiteren Stickstoff- oder Sauerstoffatom verbunden ist, und wobei der Heterocyclus gegebenenfalls noch ein oder zwei weitere Sauerstoff-, Stickstoff und/oder Schwefelatome enthält, wobei jedoch keine zwei Sauerstoffatome direkt benachbart stehen können,

15

R für gegebenenfalls einfach bis fünffach substituiertes Aryl steht, und

20

X für Halogen steht,

sowie Säureadditionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

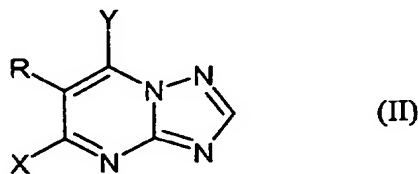
25

G für gegebenenfalls substituiertes, mono- oder polycyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl steht, das über ein Stickstoffatom gebunden ist, wobei dieses Stickstoffatom im Heterocyclus mit einem weiteren Stickstoffatom verbunden ist, und wobei der

Heterocyclus gegebenenfalls noch ein oder zwei weitere Sauerstoff-, Stickstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei jedoch keine zwei Sauerstoffatome direkt benachbart stehen können.

- 5      2.      Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



10

in welcher

R und X      die oben angegebenen Bedeutungen haben und

15

Y      für Halogen steht,

mit Heterocyclen der Formel

20

G-H      (III)

in welcher

G      die oben angegebene Bedeutung hat,

25

oder mit Säureadditionssalzen von Heterocyclen der Formel (III)

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt.

3. Mikrobizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. an einem Säureadditions-Salz davon neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.  
5
4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. von deren Säureadditions-Salzen zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.  
10
5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.  
15
6. Verfahren zur Herstellung von mikrobiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.  
20

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No  
 PCT/EP 03/03833

 A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
 IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

 Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
 IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| X          | EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>8 April 1998 (1998-04-08)<br>Seite 4, Zeilen 19-38<br>claim 1                             | 1-6                   |
| A          | US 6 284 762 B1 (PFRENGLE WALDEMAR)<br>4 September 2001 (2001-09-04)<br>claim 1  | 1-6                   |
| P, X       | WO 02 46195 A (BASF AG)<br>13 June 2002 (2002-06-13)<br>claim 1  | 1-6                   |
| P, X       | WO 03 008416 A (GRAMMENOS WASSILIOS<br>; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE);<br>GEWEH) 30 January 2003 (2003-01-30)<br>claim 1 | 1-6                   |
|            | -/-  |                       |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 August 2003

Date of mailing of the international search report

03/09/2003

Name and mailing address of the ISA

 European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Wolf, C

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 03/03833

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| P, X       | WO 03 008415 A (GRAMMENOS WASSILIOS<br>;RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE);<br>GEWEH) 30 January 2003 (2003-01-30)<br>Anspruch 1; Seite 5, Zeilen 14-33<br>----- | 1-6                   |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 03/03833

| Patent document<br>cited in search report |    | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|----|---------------------|----------------------------|---------------------|
| EP 0834513                                | A  | 08-04-1998          | US 5817663 A               | 06-10-1998          |
|   |    |                     | AT 221069 T                | 15-08-2002          |
|   |    |                     | DE 69714171 D1             | 29-08-2002          |
|   |    |                     | DE 69714171 T2             | 12-12-2002          |
|   |    |                     | EP 0834513 A2              | 08-04-1998          |
|   |    |                     | JP 10152489 A              | 09-06-1998          |
|   |    |                     | US 5965561 A               | 12-10-1999          |
|   |    |                     |                            |                     |
| US 6284762                                | B1 | 04-09-2001          | AT 239727 T                | 15-05-2003          |
|   |    |                     | AT 228133 T                | 15-12-2002          |
|   |    |                     | AU 752669 B2               | 26-09-2002          |
|   |    |                     | AU 3098599 A               | 18-10-1999          |
|   |    |                     | AU 735730 B2               | 12-07-2001          |
|   |    |                     | AU 6867198 A               | 11-11-1998          |
|   |    |                     | BG 103805 A                | 30-06-2000          |
|   |    |                     | BR 9808531 A               | 23-05-2000          |
|   |    |                     | BR 9909009 A               | 28-11-2000          |
|   |    |                     | CA 2324154 A1              | 30-09-1999          |
|   |    |                     | CN 1302299 T               | 04-07-2001          |
|   |    |                     | CZ 20003472 A3             | 16-01-2002          |
|   |    |                     | CZ 292092 B6               | 16-07-2003          |
|   |    |                     | DE 69814375 D1             | 12-06-2003          |
|   |    |                     | DE 69903988 D1             | 02-01-2003          |
|   |    |                     | DE 69903988 T2             | 27-03-2003          |
|   |    |                     | DK 975635 T3               | 02-06-2003          |
|   |    |                     | DK 945453 T3               | 16-12-2002          |
|   |    |                     | EA 2906 B1                 | 31-10-2002          |
|   |    |                     | EE 9900486 A               | 15-06-2000          |
|   |    |                     | EP 0975635 A1              | 02-02-2000          |
|   |    |                     | EP 0945453 A1              | 29-09-1999          |
|   |    |                     | EP 1066291 A1              | 10-01-2001          |
|   |    |                     | ES 2188094 T3              | 16-06-2003          |
|   |    |                     | HU 0001993 A2              | 28-10-2000          |
|   |    |                     | HU 0101751 A2              | 28-10-2001          |
|   |    |                     | JP 11322750 A              | 24-11-1999          |
|   |    |                     | JP 2001520650 T            | 30-10-2001          |
|   |    |                     | JP 2003522100 T            | 22-07-2003          |
|   |    |                     | NO 994973 A                | 13-10-1999          |
|   |    |                     | NZ 500143 A                | 29-06-2001          |
|   |    |                     | PL 343176 A1               | 30-07-2001          |
|   |    |                     | PT 945453 T                | 31-03-2003          |
|   |    |                     | SK 141499 A3               | 11-09-2001          |
|   |    |                     | WO 9948893 A1              | 30-09-1999          |
|   |    |                     |                            |                     |
| WO 0246195                                | A  | 13-06-2002          | WO 0246195 A1              | 13-06-2002          |
|   |    |                     | AU 2362901 A               | 18-06-2002          |
| WO 03008416                               | A  | 30-01-2003          | WO 03008416 A1             | 30-01-2003          |
|   |    |                     |                            |                     |
| WO 03008415                               | A  | 30-01-2003          | WO 03008415 A1             | 30-01-2003          |

PCT/EP 03/03833

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

### C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

**X** Siehe Anhang Patentfamilie

- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*G\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts

03/09/2003

**Bevollmächtigter Bediensteter**

Wolf, C.

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/03833

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile   | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| P, X       | <p>WO 03 008415 A (GRAMMENOS WASSILIOS<br/>;RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE);<br/>GEWEH) 30. Januar 2003 (2003-01-30)<br/>Anspruch 1; Seite 5, Zeilen 14-33</p> <p>-----</p> | 1-6                |



## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/03833

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument |    | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|----|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0834513   | A  | 08-04-1998                    | US 5817663 A                      | 06-10-1998                    |
|  |    |                               | AT 221069 T                       | 15-08-2002                    |
|  |    |                               | DE 69714171 D1                    | 29-08-2002                    |
|  |    |                               | DE 69714171 T2                    | 12-12-2002                    |
|  |    |                               | EP 0834513 A2                     | 08-04-1998                    |
|  |    |                               | JP 10152489 A                     | 09-06-1998                    |
|  |    |                               | US 5965561 A                      | 12-10-1999                    |
| <hr/>  |    |                               |                                   |                               |
| US 6284762   | B1 | 04-09-2001                    | AT 239727 T                       | 15-05-2003                    |
|  |    |                               | AT 228133 T                       | 15-12-2002                    |
|  |    |                               | AU 752669 B2                      | 26-09-2002                    |
|  |    |                               | AU 3098599 A                      | 18-10-1999                    |
|  |    |                               | AU 735730 B2                      | 12-07-2001                    |
|  |    |                               | AU 6867198 A                      | 11-11-1998                    |
|  |    |                               | BG 103805 A                       | 30-06-2000                    |
|  |    |                               | BR 9808531 A                      | 23-05-2000                    |
|  |    |                               | BR 9909009 A                      | 28-11-2000                    |
|  |    |                               | CA 2324154 A1                     | 30-09-1999                    |
|  |    |                               | CN 1302299 T                      | 04-07-2001                    |
|  |    |                               | CZ 20003472 A3                    | 16-01-2002                    |
|  |    |                               | CZ 292092 B6                      | 16-07-2003                    |
|  |    |                               | DE 69814375 D1                    | 12-06-2003                    |
|  |    |                               | DE 69903988 D1                    | 02-01-2003                    |
|  |    |                               | DE 69903988 T2                    | 27-03-2003                    |
|  |    |                               | DK 975635 T3                      | 02-06-2003                    |
|  |    |                               | DK 945453 T3                      | 16-12-2002                    |
|  |    |                               | EA 2906 B1                        | 31-10-2002                    |
|  |    |                               | EE 9900486 A                      | 15-06-2000                    |
|  |    |                               | EP 0975635 A1                     | 02-02-2000                    |
|  |    |                               | EP 0945453 A1                     | 29-09-1999                    |
|  |    |                               | EP 1066291 A1                     | 10-01-2001                    |
|  |    |                               | ES 2188094 T3                     | 16-06-2003                    |
|  |    |                               | HU 0001993 A2                     | 28-10-2000                    |
|  |    |                               | HU 0101751 A2                     | 28-10-2001                    |
|  |    |                               | JP 11322750 A                     | 24-11-1999                    |
|  |    |                               | JP 2001520650 T                   | 30-10-2001                    |
|  |    |                               | JP 2003522100 T                   | 22-07-2003                    |
|  |    |                               | NO 994973 A                       | 13-10-1999                    |
|  |    |                               | NZ 500143 A                       | 29-06-2001                    |
|  |    |                               | PL 343176 A1                      | 30-07-2001                    |
|  |    |                               | PT 945453 T                       | 31-03-2003                    |
|  |    |                               | SK 141499 A3                      | 11-09-2001                    |
|  |    |                               | WO 9948893 A1                     | 30-09-1999                    |
| <hr/>  |    |                               |                                   |                               |
| WO 0246195   | A  | 13-06-2002                    | WO 0246195 A1                     | 13-06-2002                    |
|  |    |                               | AU 2362901 A                      | 18-06-2002                    |
| <hr/>  |    |                               |                                   |                               |
| WO 03008416  | A  | 30-01-2003                    | WO 03008416 A1                    | 30-01-2003                    |
| <hr/>  |    |                               |                                   |                               |
| WO 03008415  | A  | 30-01-2003                    | WO 03008415 A1                    | 30-01-2003                    |
| <hr/>  |    |                               |                                   |                               |